

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019年更新版）に準拠して作成

持続性経口ペニシリン製剤

ベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒

**バイシリン<sup>®</sup> G顆粒40万単位**BICILLIN<sup>®</sup> G Granules 400,000 units

剤形	顆粒剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1g中に日本薬局方ベンジルペニシリンベンザチン水和物40万単位を含有
一般名	和名：ベンジルペニシリンベンザチン水和物 洋名：Benzylpenicillin Benzathine Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007年3月22日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007年6月15日（販売名変更による） 販売開始年月日：1981年9月1日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元： <b>MSD株式会社</b>
医薬情報担当者の連絡先	TEL. : FAX. :
問い合わせ窓口	MSDカスタマーサポートセンター 医療関係者の方：フリーダイヤル 0120-024-961 <受付時間> 9:00～17:30（土日祝日・当社休日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.msconnect.jp/">https://www.msconnect.jp/</a>

本IFは2021年9月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

(2020年4月改訂)

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>9</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 効能又は効果 .....	9
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 効能又は効果に関連する注意 .....	9
3. 製品の製剤学的特性.....	1	3. 用法及び用量 .....	9
4. 適正使用に関して周知すべき特性 .....	1	4. 用法及び用量に関連する注意 .....	9
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	2	5. 臨床成績 .....	10
6. RMP の概要.....	2	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>11</b>
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>3</b>	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群..	11
1. 販売名 .....	3	2. 薬理作用 .....	11
2. 一般名 .....	3	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>14</b>
3. 構造式又は示性式.....	3	1. 血中濃度の推移 .....	14
4. 分子式及び分子量.....	3	2. 薬物速度論的パラメータ .....	14
5. 化学名（命名法）又は本質.....	3	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3	4. 吸収 .....	15
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	5. 分布 .....	15
1. 物理化学的性質.....	4	6. 代謝.....	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4	7. 排泄 .....	16
3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....	5	8. トランスポーターに関する情報 .....	16
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>6</b>	9. 透析等による除去率 .....	16
1. 剤形.....	6	10. 特定の背景を有する患者 .....	16
2. 製剤の組成.....	6	11. その他 .....	16
3. 添付溶解液の組成及び容量 .....	7	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> ..	<b>17</b>
4. 力価.....	7	1. 警告内容とその理由 .....	17
5. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7	2. 禁忌内容とその理由 .....	17
6. 製剤の各種条件下における安定性 .....	7	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由..	17
7. 調製法及び溶解後の安定性 .....	7	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由..	17
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	7	5. 重要な基本的注意とその理由 .....	17
9. 溶出性.....	7	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	18
10. 容器・包装.....	7	7. 相互作用 .....	19
11. 別途提供される資材類.....	8	8. 副作用 .....	19
12. その他.....	8	9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	20
		10. 過量投与 .....	20

11. 適用上の注意.....	20	<b>XI. 文献.....</b>	<b>24</b>
12. その他の注意.....	20	1. 引用文献.....	24
<b>IX. 非臨床試験に関する項目.....</b>	<b>21</b>	2. その他の参考文献.....	24
1. 薬理試験.....	21	<b>XII. 参考資料.....</b>	<b>25</b>
2. 毒性試験.....	21	1. 主な外国での発売状況.....	25
<b>X. 管理的事項に関する項目.....</b>	<b>22</b>	2. 海外における臨床支援情報.....	25
1. 規制区分.....	22	<b>XIII. 備考.....</b>	<b>26</b>
2. 有効期間.....	22	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を 行うにあたっての参考情報.....	26
3. 包装状態での貯法.....	22	2. その他の関連資料.....	26
4. 取扱い上の注意.....	22		
5. 患者向け資材.....	22		
6. 同一成分・同効薬.....	22		
7. 国際誕生年月日.....	22		
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、 薬価基準収載年月日、販売開始年月日.....	22		
9. 効能又は効果追加、用法及び用量 変更追加等の年月日及びその内容.....	22		
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容.....	23		
11. 再審査期間.....	23		
12. 投薬期間制限に関する情報.....	23		
13. 各種コード.....	23		
14. 保険給付上の注意.....	23		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

バイシリン®G 顆粒 40 万単位は、ベンジルペニシリンベンザチンの製剤である。

ベンジルペニシリン（ペニシリン G）は、主としてグラム陽性菌に対し強力な抗菌作用をあらわし、連鎖球菌、肺炎球菌などによる感染症に優れた効果を示す。

しかしながら、経口投与では十分な臨床効果が得られないことや、有効血中濃度の持続時間の短いことが欠点とされていた。

ベンジルペニシリンベンザチンは、これらの欠点を補う目的で 1951 年米国において William F. Brauce らにより開発されたベンジルペニシリンの誘導体である。

本剤は酸に安定で、経口投与において有効血中濃度が得られ、かつ長時間持続する遷延性ペニシリン製剤として開発された。

本邦において、バイシリン®G 顆粒は 1978 年 8 月 1 日に製造販売承認され、1981 年 9 月 1 日に発売された。

1993 年 6 月 4 日には医療用医薬品再評価の結果として、【効能又は効果】の〈適応菌種〉のうち「ベンジルペニシリンに感性のブドウ球菌、淋菌」が削除され、〈適応症〉のうち「膿皮症、膿痂疹、せつ、せつ腫症、よう、蜂か織炎、乳腺症、淋疾」が削除されることが通知された。【用法及び用量】については記載表現が変更されたが、内容についての変更はなかった。また、2004 年 9 月 30 日には医療用医薬品再評価の結果として、【効能又は効果】の〈適応症〉のうち「細菌性心内膜炎」が削除され、【用法及び用量】についても「細菌性心内膜炎」に関する内容が削除された。

## 2. 製品の治療学的特性

- (1) 経口投与で有効血中濃度が得られる持続性経口ペニシリン製剤である。（「VII. 1. 血中濃度の推移」の項参照）
- (2) 内服後、連鎖球菌、肺炎球菌、梅毒スピロヘータのように感受性の高い病原体に殺菌的に作用する。（「VI. 2. 薬理作用」の項参照）
- (3) 重大な副作用として、ショック、溶血性貧血、間質性腎炎、急性腎障害、偽膜性大腸炎があらわれることがある。（「VIII. 8. 副作用」の項参照）

## 3. 製品の製剤学的特性

経口ペニシリン剤特有の苦味がない。（「IV. 製剤に関する項目」参照）

## 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有 無	タイトル、参照先等
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

I. 概要に関する項目

---

**5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項**

**(1) 承認条件**

該当しない

**(2) 流通・使用上の制限事項**

該当しない

**6. RMPの概要**

該当しない

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

バイシリン®G 顆粒 40万単位

#### (2) 洋名

BICILLIN® G Granules 400,000 units

#### (3) 名称の由来

1分子あたりペニシリン (penicillin) が2つ (bi) 存在することから、Bicillin と命名した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ベンジルペニシリンベンザチン水和物 (JAN)

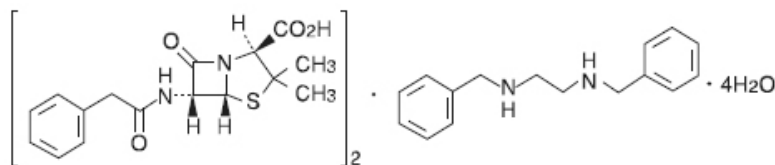
#### (2) 洋名 (命名法)

Benzylpenicillin Benzathine Hydrate (JAN)

#### (3) ステム (stem)

-cillin : antibiotics, 6-aminopenicillanic acid derivatives

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 :  $(C_{16}H_{18}N_2O_4S)_2 \cdot C_{16}H_{20}N_2 \cdot 4H_2O$

分子量 : 981.18

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

(2*S*,5*R*,6*R*)-3,3-Dimethyl-7-oxo-6-[(phenylacetyl)amino]-4-thia- 1-azabicyclo[3.2.0]heptane-2-carboxylic acid hemi(*N,N'*-dibenzylethane-1,2-diamine) dihydrate

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : PCG (ベンジルペニシリン)



---

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

### 1. 物理化学的性質

#### (1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

#### (2) 溶解性

メタノール又はエタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

#### (3) 吸湿性

臨界相対湿度：37℃ - 88%（参考値）

#### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：123～124℃（分解）

#### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

#### (6) 分配係数

該当資料なし

#### (7) その他の主な示性値

$[\alpha]_D^{25}$  : +206° (c 0.105, ホルムアミド)

溶液の液性（pH）及び安定な pH 域：4.0～7.5（飽和水溶液）

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は、乾燥状態で 55℃に 1 年間放置した時、力価の低下を認めない。

また、1 mL 当たり 30 万単位を含有する水性または油性（2%アルミニウムモノステアレート加大豆油）懸濁液は 37℃に 1 年間放置しても力価の低下を認めない。

しかし、他の PCG 誘導体と同様にペニシリナーゼ（β-ラクタマーゼ）に対しては不安定で、短時間に不活化される。

Ⅲ. 有効成分に関する項目

各種条件下におけるベンジルペニシリンベンザチンの安定性

	保存条件	保存期間	保存形態	結 果
長期安定性試験	室温	5年間	気密容器	外観、力価、含湿度に変化なし pHはわずかに低下
苛酷試験	40℃	2カ月	気密容器	外観は微黄色に変色 力価は約4%低下 pHは変化なし
	60℃	2カ月	気密容器	外観は黄色に変色 力価は約15%低下 pHはわずかに低下
	光照射 (蛍光灯下)	(1)	シャーレ (開放)	外観、力価、pHに 変化なし
	光照射 (殺菌灯下)	(2)	シャーレ (開放)	外観は淡黄色に変色 力価は約3%低下 pHはわずかに低下

(1) 照射条件：直径 85 mm のシャーレに試料 3 g を広げ、試料上の明るさが 2500 ルクスになるような位置に白色蛍光灯を置き、120 万 Lux・hr になるまで照射した。

(2) 照射条件：直径 85 mm のシャーレに試料 3 g を広げ、殺菌灯（三菱殺菌ランプ；GL-10）を試料の上方 50 cm の位置に置き、24 時間紫外線を照射した。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日局「ベンジルペニシリンベンザチン水和物」による。

定量法

日局「ベンジルペニシリンベンザチン水和物」による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

顆粒剤

#### (2) 製剤の外観及び性状

販 売 名	性 状		
	色 調	形 状	におい
バイシリン®G 顆粒 40万単位	うすい赤色	顆 粒	芳 香

#### (3) 識別コード

該当しない

#### (4) 製剤の物性

物 性		
安息角	34.7	
崩潰角	32.3	
疎充填かさ密度（静かかさ密度）	0.63	g/mL
密充填かさ密度 （タッピング法かさ密度）	0.70	g/mL
圧縮度	9.7	%
分散度	34.3	%
飛散性	逃飛率	9.7 %
	集合率	-

#### (5) その他

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	バイシリン®G 顆粒 40万単位
有効成分	日本薬局方 ベンジルペニシリンベンザチン水和物
分量	1 g 中に 40万単位
添加剤	クエン酸ナトリウム水和物、安息香酸ナトリウム、サッカリンナトリウム水和物、トウモロコシデンプン、赤色 102 号、精製白糖、香料、レシチン、トウイーン

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (3) 熱量

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

##### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

##### 4. 力価

本剤の力価はペニシリンの力価としての単位を表す。

##### 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

##### 6. 製剤の各種条件下における安定性

<顆粒剤>

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40℃	6 ヶ月	ガラス製気密容器 セロポリ分包 メタル分包	外観、含湿度、崩壊性及び力価にほとんど変化はなく、TLCにも異常は認められない。
室温 60～70% R.H.	14 日	無包装	吸湿性、力価、TLCに変化なし。
	1 ヶ月	セロポリ分包	吸湿性、力価、TLCに変化なし。
35℃ 81% R.H.	5 日	無包装	吸湿が認められた*
	1 ヶ月	セロポリ分包	吸湿性、力価、TLCに変化なし。
35℃ 92% R.H.	3 日	無包装	アメ状となった*
	14 日	セロポリ分包	吸湿性、力価、TLCに変化なし。
紫外線照射 (2537Å)	24 時間		外観、力価、含湿度、崩壊性、TLCに変化なし。
室温	36 ヶ月	ガラス製気密容器 セロポリ分包 メタル分包	外観、力価、含湿度、崩壊性、TLCに変化なし。

\*吸湿した場合、外観は塊状（またはアメ状）になるが、力価低下は認められなかった。

##### 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

##### 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

##### 9. 溶出性

該当資料なし

##### 10. 容器・包装

###### (1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

###### (2) 包装

1 g 中 40 万単位：100 g [瓶、乾燥剤入り]

IV. 製剤に関する項目

---

**(3) 予備容量**

該当しない

**(4) 容器の材質**

瓶	キャップ
ポリエチレン	ポリプロピレン

**11. 別途提供される資材類**

該当資料なし

**12. その他**

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

〈適応菌種〉

ベンジルペニシリンに感性のレンサ球菌属、肺炎球菌、梅毒トレポネーマ

〈適応症〉

リンパ管・リンパ節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、梅毒、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱、リウマチ熱の発症予防

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>1)</sup>を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

(解説)

2019年(令和元年)12月5日に厚生労働省健康局結核感染症課より発行された「抗微生物薬適正使用の手引き 第二版」に基づき、抗微生物薬の適正使用がなされるよう注意喚起を行うため、追記された『中耳炎』を〈効能・効果に関連する使用上の注意〉に追記した。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6. 用法及び用量

通常、成人にはベンジルペニシリンベンザチン水和物として1回40万単位を1日2~4回経口投与する。

梅毒に対しては、通常、成人1回40万単位を1日3~4回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(解説)

本剤は1g中に日本薬局方ベンジルペニシリンベンザチン水和物40万単位を含有するうすい赤色の顆粒剤である。

〈製剤換算量〉

適応症	成人への通常投与量
リンパ管・リンパ節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱、リウマチ熱の発症予防	1回1gを1日2~4回経口投与
梅毒	1回1gを1日3~4回経口投与

なお、年齢、症状により適宜増減する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

承認までに実施した試験結果等から設定した。

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

**5. 臨床成績**

**(1) 臨床データパッケージ**

該当しない

**(2) 臨床薬理試験**

該当資料なし

**(3) 用量反応探索試験**

該当資料なし

**(4) 検証的試験**

**1) 有効性検証試験**

該当資料なし

**2) 安全性試験**

該当資料なし

**(5) 患者・病態別試験**

該当資料なし

**(6) 治療的使用**

**1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容**

該当しない

**2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要**

該当しない

**(7) その他**

該当資料なし

---

## VI. 薬効薬理に関する項目

---

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ペニシリン系抗生物質

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：細菌の細胞壁

作用機序：細菌の細胞壁合成を阻害することにより殺菌的に作用する。

バイシリンは、血中で活性体であるペニシリン G となって作用する。薬理作用は、主としてペプチド転移酵素反応の阻害による。

ペニシリン系抗生物質がペプチド転移酵素反応を阻害する理由としては、その構造がペプチドグリカンの D-Ala-D-Ala 末端と類似しているために、基質の代わりに、これらの抗生物質が酵素の活性中心と結合するためと考えられている。β-ラクタム環の CO-N 結合は反応性に富むが、これが D-Ala-D-Ala の CO-N 結合に相当しており、β-ラクタム環の CO-N 結合が開裂し、ペプチド転移酵素と結合し、ペニシロイル酵素をつくることが推定されている。



VI. 薬効薬理に関する項目

(2) 薬効を裏付ける試験成績

抗菌作用：連鎖球菌、肺炎球菌<sup>注)</sup> に対し強い抗菌力を有する<sup>2)4)</sup>。また、梅毒トレポネーマ<sup>注)</sup> に対しても強力に作用する。

注) 菌種名は承認申請資料に基づき記載している。

表. 抗菌スペクトル<sup>5)</sup> (\*: 適応外菌種)

\*菌種名は承認申請資料に基づき記載している。

標準菌株		MIC (µg/mL)		
		PCG	ABPC	
グラム陽性菌	<i>Staph. pyogenes</i> (Oxford) (*)	1227	0.02	0.05
	<i>Staph. pyogenes</i> (Smith) (*)	1474	0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*)	1232	0.01	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*)	1233	0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*)	NCIB 8588	0.02	0.06
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*)	1399	0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*)	1402	0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*)	1083	125.0	125.0
	<i>Strep. pyogenes</i> β type	1489	0.005	0.01
	<i>Strep. pyogenes</i> β type	1490	0.01	0.02
	<i>Strep. pyogenes</i> β type	1488	0.06	0.01
	<i>Strep. pyogenes</i> α type	1479	0.005	0.02
	<i>Strep. pyogenes</i> α type	1482	0.005	0.01
	<i>Diplococcus pneumoniae</i>	1222	0.05	0.02
	<i>Diplococcus pneumoniae</i>	1224	0.02	0.05
	<i>Diplococcus pneumoniae</i>	1251	0.1	0.02
	<i>Streptococcus faecalis</i> (*)	1591	2.5	1.25
	<i>Streptococcus faecalis</i> (*)	NCIB 8191	12.5	5.0
<i>Streptococcus faecalis</i> (*)	NCIB 8192	12.5	5.0	
<i>Streptococcus faecalis</i> (*)	1274	1.25	1.25	
標準菌株		MIC (µg/mL)		
		PCG	ABPC	
グラム陰性菌	<i>Neisseria catarrhalis</i> (*)	NCTC 3622	0.005	0.12
	<i>Haemophilus influenzae</i> (*)	1584	0.5	0.5
	<i>Haemophilus influenzae</i> (*)	1585	0.5	0.25
	<i>Haemophilus influenzae</i> (*)	1583	0.5	0.25
	<i>Haemophilus parainfluenzae</i> (*)	1586	0.25	0.12
	<i>Alcaligenes faecalis</i> (*)	NCIB 8156	5.0	5.0
	<i>Escherichia coli</i> (*)	1014	50.0	5.0
	<i>Escherichia coli</i> (*)	1015	25.0	2.5
	<i>Escherichia coli</i> (*)	1590	50.0	5.0
	<i>Escherichia coli</i> (*)	1589	25.0	2.5
	<i>Escherichia coli</i> (*)	1013	25.0	5.0
	<i>Aerobacter aerogenes</i> (*)	NCIB 418	250.0	250.0
	<i>Klebsiella pneumoniae</i> (*)	1052	6.25	1.25
	<i>Shigella shigaei</i> (*)	NCTC 4837	5.0	0.5
	<i>Shigella shimitzi</i> (*)	1079	5.0	0.6
	<i>Shigella flexneri</i> (*)	1078	12.5	1.25
	<i>Shigella sonnei</i> (*)	NCTC 8220	50.0	5.0
	<i>Salmonella paratyphi</i> A (*)	1070	6.25	0.6
	<i>Salmonella paratyphi</i> B (*)	1385	5.0	1.25
	<i>Salmonella typhi</i> (*)	NCTC 8393	2.5	0.25
	<i>Salmonella typhimurium</i> (*)	1416	6.25	1.25
	<i>Proteus vulgaris</i> (*)	1055	5.0	5.0
	<i>Proteus vulgaris</i> (*)	NCTC 401	25.0	5.0
<i>Proteus mirabilis</i> (*)	1431	5.0	1.25	
<i>Proteus morgani</i> (*)	NCTC 2815	500.0	62.5	
<i>Pseudomonas pyocyanea</i> (*)	1058	500.0	250.0	

(培地: "Oxoid" No.2, 37°C, 24hrs)

## VI. 薬効薬理に関する項目

---

### (3) 作用発現時間・持続時間

原因菌、重症度等により異なる。

## VII. 薬物動態に関する項目

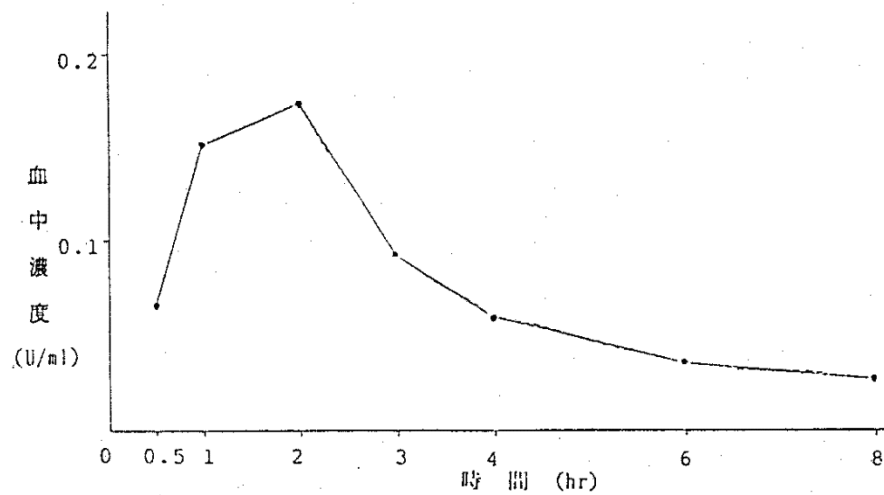
### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

原因菌、症例により異なる。

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人 (n=12) に、ベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒 40 万単位を経口投与した場合、血中濃度のピークは 2 時間後にあり、その平均値は 0.17 単位/mL を示し、8 時間後には 0.02 単位/mL を認めた。



#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

空腹時投与でバイシリンの血中濃度は急速に高くなるが、食事と共に投与すると、よりよく有効濃度が維持され、その差異は僅少である<sup>6)</sup>。

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

#### (5) 分布容積

該当資料なし

**(6) その他**

該当資料なし

**3. 母集団（ポピュレーション）解析**

**(1) 解析方法**

該当資料なし

**(2) パラメータ変動要因**

該当資料なし

**4. 吸収**

消化管（小腸上部）から吸収される。

**5. 分布**

**(1) 血液—脳関門通過性**

該当資料なし

**(2) 血液—胎盤関門通過性**

該当資料なし

**(3) 乳汁への移行性**

該当資料なし

**(4) 髄液への移行性**

該当資料なし

**(5) その他の組織への移行性**

該当資料なし

**(6) 血漿蛋白結合率**

該当資料なし

**6. 代謝**

**(1) 代謝部位及び代謝経路**

該当資料なし

**(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率**

該当資料なし

**(3) 初回通過効果の有無及びその割合**

該当資料なし

**(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率**

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

---

### 7. 排泄

#### (1) 排泄部位及び経路

主として腎臓

#### (2) 排泄率

健康成人 (n = 12) に、ベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒 40 万単位を経口投与した場合、8 時間までの平均尿中排泄率は、14.5%であった。

#### (3) 排泄速度

該当資料なし

### 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

### 9. 透析等による除去率

該当資料なし

### 10. 特定の背景を有する患者

小児にベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒 50 万単位を経口投与した時の AUC は、3 時間後で  $8.85 \pm 3.58 \text{ min} \cdot \mu\text{g/mL}$ 、6 時間後には  $14.52 \pm 5.02 \text{ min} \cdot \mu\text{g/mL}$  であった<sup>7)</sup>。

### 11. その他

該当資料なし

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

β-ラクタム系抗生物質（ペニシリン系、セフェム系、カルバペネム系、モノバクタム系等）に共通の注意事項である。このような患者は過敏症の再発の可能性が高いと考えられるため、本剤の投与は避ける必要がある。（「VIII. 6. (1) 合併症・既往歴等のある患者」9.1.1の項参照）

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

8.1 本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。

8.2 ショックを起こすことがあるので、十分な問診を行うこと。[11.1.1 参照]

8.3 重篤な血液障害があらわれることがあるので、定期的に検査を実施するなど観察を十分に行うこと。[11.1.2 参照]

8.4 重篤な腎障害があらわれることがあるので、定期的に検査を実施するなど観察を十分に行うこと。[11.1.3 参照]

（解説）

\*（解説）の番号は添付文書の項番号に対応

8.1 耐性菌の発現を防ぐため、専門医による指導のもと、使用する抗菌薬（本剤を含む）に対する感受性を確認した上で使用すること。

8.2 平成 16 年 9 月 29 日付薬食安発第 0929005 号に基づき、注射用抗生物質製剤に共通の注意事項として設定した。ショックはアレルギー反応の中で最も重大なもので、早期に発見し、適切な治療がなされなければ、重篤な転帰をとりうる副作用である。

予知のために問診等を実施し、投与に際してはショック発現時に救急処置のとれる準備をしておくこと。また、投与後、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うことが重要である。

8.3 本剤の投与後に重篤な血液障害を発現することがある。定期的に血液検査を行い、患者の状態を十分に観察する必要があることから設定した。

8.4 本剤の投与後に重篤な腎障害を発現することがある。定期的に腎機能検査を行い、患者の状態を十分に観察する必要があることから設定した。

## 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

### (1) 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1 合併症・既往歴等のある患者
- 9.1.1 ペニシリン系又はセフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者（ただし、本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）
- 9.1.2 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

（解説）

- 9.1.1 β-ラクタム系抗生物質に共通の注意事項である。過敏症の既往歴のある患者は本剤投与によりショック又は過敏症を起こす可能性が高いと考えられるため設定した。
- 9.1.2 β-ラクタム系抗生物質に共通の注意事項である。アレルギー体質を有する患者は、アレルギー反応を示す傾向が高いと考えられるため設定した。

### (2) 腎機能障害患者

- 9.2 腎機能障害患者
- 9.2.1 高度の腎機能障害のある患者  
投与量を減ずる、投与間隔をあけるなど、投与量・投与間隔の適切な調節を行うこと。血中濃度が持続する。

（解説）

- 9.2.1 高度の腎障害のある患者は、本剤の排泄時間が延長し、血中濃度が上昇するため、副作用の発現率が高くなるおそれがあることから注意喚起として設定した。

### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

### (5) 妊婦

- 9.5 妊婦  
妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

（解説）

妊娠中の女性を対象とした臨床試験は実施しておらず、妊婦での安全性は確立していないため設定した。

### (6) 授乳婦

- 9.6 授乳婦  
治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

（解説）

授乳中の女性を対象とした臨床試験は実施しておらず、授乳婦及び哺乳中の児への影響は不明であるため設定した。

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (7) 小児等

設定されていない

### (8) 高齢者

#### 9.8 高齢者

減量するなど注意して投与すること。一般に生理機能が低下している。

(解説)

β-ラクタム系抗生物質に共通の注意事項である。生理機能が低下している高齢者では薬物の排泄が遅延し、副作用があらわれやすいと考えられるため設定した。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

### (2) 併用注意とその理由

設定されていない

## 8. 副作用

### 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### (1) 重大な副作用と初期症状

#### 11.1 重大な副作用

##### 11.1.1 ショック（頻度不明）

初期症状として、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等があらわれることがあるので観察を十分に行うこと。 [8.2 参照]

##### 11.1.2 溶血性貧血（頻度不明）

重篤な血液障害があらわれることがある。 [8.3 参照]

##### 11.1.3 間質性腎炎、急性腎障害（いずれも頻度不明）

重篤な腎障害があらわれることがある。 [8.4 参照]

##### 11.1.4 偽膜性大腸炎（頻度不明）

血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には直ちに投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(解説)

重大な副作用の項では、特に注意を要すると考えられる副作用について記載した。



Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用	
	頻度不明
過敏症	発熱、発疹、蕁麻疹
血液	好酸球増多症
肝臓	肝機能障害（AST 上昇、ALT 上昇）
消化器	下痢、悪心、食欲不振
その他	梅毒患者におけるヤーリッシュ・ヘルクスハイマー反応（発熱、全身倦怠感、頭痛等の発現、病変部の増悪）

（解説）

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。（再審査対象外）

◆項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

設定されていない

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (3) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### (1) 単回投与毒性試験

マウスに経口投与したときの LD<sub>50</sub> 値は、2,000 mg/kg で、腹腔内投与では、459.9 mg/kg であった<sup>8)</sup>。

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製剤：バイシリン®G 顆粒 40 万単位 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

有効成分：ベンジルペニシリンベンザチン水和物 該当しない

### 2. 有効期間

有効期間：2年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 20. 取扱い上の注意

湿気を避けるため、瓶のまま密栓して保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同効薬：経口ペニシリン系抗生物質

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
バイシリン®G 顆粒 40 万単位	2007 年 3 月 22 日	21900AMX00686000	2007 年 6 月 15 日	1981 年 9 月 1 日

### 9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2007 年、旧名バイシリン®G 顆粒において「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について」の 4 項「医療用医薬品の販売名の取扱いについて」〔平成 16 年 6 月 2 日付け厚生労働省医薬食品局長通知（薬食発第 0602009 号）〕の通知に基づき製品名をバイシリン®G 顆粒 40 万単位へ変更した。これに伴い、製造承認年月日、薬価基準収載年月日、発売年月日及び承認番号が変更になった。

旧名バイシリン®G 顆粒の承認番号、承認日、薬価基準収載日及び発売日：

承認番号	15300EMZ00792000
承認日	1978 年 8 月 1 日
薬価基準収載日	1981 年 9 月 1 日
発売日	1981 年 9 月 1 日

次項参照（医療用医薬品再評価結果に伴う変更）

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

医療用医薬品再評価結果

1993年6月4日

#### 【効能・効果】

<適応菌種>「ベンジルペニシリンに感性のブドウ球菌、淋菌」が削除され、<適応症>「膿皮症、膿痂疹、せつ、せつ腫症、よう、蜂か織炎、乳腺症、淋疾」が削除された。

#### 【用法・用量】

記載表現が変更されたが、内容についての変更はなかった。

2004年9月30日

#### 【効能・効果】

<適応症>「細菌性心内膜炎」が削除された。

#### 【用法・用量】

「細菌性心内膜炎」に関する内容が削除された。

### 11. 再審査期間

該当しない

### 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

### 13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理システム用コード
バイシリン®G 顆粒 40万単位	6111002D1039	6111002D1039	110613801	620005060

### 14. 保険給付上の注意

該当しない

---

## XI . 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 厚生労働省健康局結核感染症課編. 抗微生物薬適正使用の手引き
- 2) Sabath, L. D. et al. *Antimicrob Agents Chemother (Bethesda)*. 1970; 10: 53-6.(PMID: 4398824)
- 3) Finland, M. et al. *Antimicrob Agents Chemother*. 1976; 9: 11-9.(PMID: 176926)
- 4) 大久保暢夫 他. 感染症学雑誌. 1973; 47: 506-9.
- 5) Rolinson, G. N. et al. *Br Med J*. 1961; 2: 191-6.(PMID: 13742934)
- 6) 高野正彦. 月刊薬事. 1976; 18: 813-21.
- 7) 藤田晃三 他. 日本小児科学会雑誌. 1981; 85: 1478-9.
- 8) Seifter, J. et al. *Antibiot Chemother (Northfield)*. 1951; 1: 504-8.(PMID: 24541657)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

---

## XII. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

2021年9月現在、外国では発売されていない。

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

#### (1) 粉碎

該当資料なし

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

### 2. その他の関連資料

該当資料なし

